

⑬ 日本国特許庁 (JP)

① 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭59—39894

⑤ Int. Cl.³ 識別記号 庁内整理番号
 C 07 D 421/04 7431-4C
 A 61 K 31/41 A B G 7330-4C
 31/415 7330-4C
 31/425 7330-4C
 31/44 7169-4C
 31/47 7169-4C
 31/495 7169-4C
 31/50 7169-4C ※

④ 公開 昭和59年(1984)3月5日

発明の数 3
審査請求 未請求

(全 20 頁)

⑥ 新規なベンズイソセレナゾロン類

アー

⑦ 特 願 昭58—126274

⑧ 出 願 人 アー・ナッターマン・ウント・
 シー・ゲゼルシャフト・ミット
 ・ベシユレンクテル・ハフツン
 グ
 ドイツ連邦共和国デー-5000ケ
 ルン30ナッターマンアレー1

⑨ 出 願 昭58(1983)7月13日

優先権主張 ⑩ 1982年7月14日 ⑪ 西ドイツ
(DE) ⑫ P3226284.1

⑬ 発 明 者 アンドレ・ヴェルテル
 ドイツ連邦共和国デー-5024プ
 ルハイム・ライエルヴェーク11

⑭ 代 理 人 弁理士 山下白

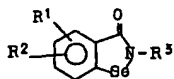
最終頁に続く

明 細 書

1. 発明の名称 新規なベンズイソセレナゾロン類

2. 特許請求の範囲

1) 一般式 I



(式中、R¹ および R² は同一であるかまたは異なることができしかも互いに独立して水素、ハロゲン、01~04 - アルキル、01~04 - アルコキシ、ヒドロキシル、トリフルオロメチル、ニトロ、ジ - (01~04 - アルキル) - アミノを表わすかあるいは R¹ および R² が一緒になつてメチレンジオキシを表わし、他方 R³ はチオフェン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール

類、ベンズイミダゾール類、ベンゾチアゾール類、ベンゾトリアジン類、ベンゾチオフェン類、ベンゾチアジアゾール類、トリアジン類、トリアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、イソキノリン類、インドール類、インダゾール類、カルバゾール類、アクリジン類、フェナジン類およびプテリジン類からなる群より選択される窒素および/または硫黄の元素のうちの1~4個のヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または飽和基を表わすが、その際その複素環式基がハロゲン、01~02 - アルキル、01~04 - アルコキシ、01~04 - アルキルチオ、ヒドロキシル、メルカプト、トリフルオロメチル、ニトロ、フェニル、ニトリルおよびカルボキシルまたは01~04 - アルコキシカルボニルによりモノ置換または同一かまたは異なるつたもので置換されうるこ

とが可能である)のベンズイソセレナゾロン類。

- 2) R¹ および R² は同一であるかまたは異なることができしかも互いに独立して水素、弗素、塩素、臭素、ヒドロキシル、メトキシ、トリフルオロメチル、ニトロおよび/またはメチレンジオキシを表わし、他方R³はチオフェン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾール類またはテトラゾール類からなる群より選択される窒素および/または硫黄の元素のうちの1~4個のヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または飽和基を表わすが、その際、その複素環式基が弗素、塩素、臭素、メチル、

エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ヒドロキシル、メルカプト、トリフルオロメチル、ニトロ、フェニル、ニトリル、カルボキシルおよび/またはメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルによりモノ置換または同一かまたは異なつたもので置換されることが可能である前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾロン類。

- 3) R¹ および R² は同一であるかまたは異なることができ、しかも互いに独立して水素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロおよび/またはメチレンジオキシを表わし、他方R³はチオフェン類、チアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ベンゾチアゾール類およびベンズイミダゾール類からなる群より選択される窒素および/または硫黄の元素のうちの1~2

個のヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または飽和基を表わすが、その際その複素環式基が弗素、塩素、臭素、メチル、メトキシ、エトキシ、メチルメルカプト、ヒドロキシル、メルカプト、ニトリル、ニトロ、フェニル、カルボキシルおよび/またはメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルによりモノ置換または同一かまたは異なつたもので置換されることが可能である前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾロン類。

- 4) 2-(2-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特許請求の範囲第1項記載のベンズイソセレナゾロン類。
5) 2-(3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特

許請求の範囲第1項記載のベンズイソセレナゾロン類。

- 6) 2-(4-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特許請求の範囲第1項記載のベンズイソセレナゾロン類。
7) 2-(2-クロロ-3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特許請求の範囲第1項記載のベンズイソセレナゾロン類。
8) 2-(2-チアゾリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特許請求の範囲第1項記載のベンズイソセレナゾロン類。
9) 2-(2-ベンゾチアゾリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンである前記特許請求の範囲第1項記載のベンズイ

- ソセレナゾロン類。
- 10) 2 - (3 - スルホラニル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3 (2H) - オンである前
記特許請求の範囲第 1 項記載のベンズイソセ
レナゾロン類。
- 11) 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3 (2H) - オンである前
記特許請求の範囲第 1 項記載のベンズイソセ
レナゾロン類。
- 12) 2 - (2,6 - ジクロロ - 3 - ピリジル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オンである前記特許請求の範囲第 1 項記載の
ベンズイソセレナゾロン類。
- 13) 2 - (6 - メトキシ - 3 - ピリジル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン
である前記特許請求の範囲第 1 項記載のベン
ズイソセレナゾロン類。

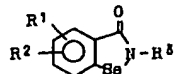
一般式 I のベンズイソセレナゾロンを得ること
を特徴とする前記特許請求の範囲第 1 ~ 15
項のいずれか一つに記載の化合物の製法。

- 17) 活性成分としての前記特許請求の範囲第 1
~ 15 項のいずれか一つに記載の式 I の化合
物を薬学的補助剤およびビヒクルと混合して
含有することを特徴とする製剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は新規なベンズイソセレナゾロン類、
それらの製法およびリウマチ系の炎症性疾患の
治療用薬剤における活性成分としてのそれらの
使用に關する。

本発明による化合物は一般式 I

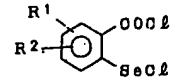


[式中、R¹ および R² は同一であるかまたは異
なることができ、しかも互いに独立して水素、

- 14) 2 - (5 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン
である前記特許請求の範囲第 1 項記載のベン
ズイソセレナゾロン類。

- 15) 2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリジル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オンである前記特許請求の範囲第 1 項記載の
ベンズイソセレナゾロン類。

- 16) 一般式 II



(式中、R¹ および R² は式 I の場合と同じ意
味を有する) のベンゾイルクロライドを閉環
条件下で一般式 III



(式中、R³ は式 I に示された意味を有する)
の複素環式アミンと反応させることにより一

ハロゲン、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-アルコ
キシ、ヒドロキシル、トリフルオロメチル、ニ
トロ、ジ (C₁~C₄-アルキル) アミノを表わす
かあるいは R¹ と R² とは一緒になつてメチレン
ジオキシを表わし、他方 R³ はチオフェン類、チ
アゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール
類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジ
ン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン
類、ペンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール
類、ペンゾトリアゾール類、トリアジン類、ト
リアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、
イソキノリン類、インドール類、インダゾール
類、カルバゾール類、アクリジン類、フェナジ
ン類およびプテリジン類からなる群より選択さ
れる鹽基および/または硫酸である 1 ~ 4 個の
ヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または
飽和基を表わすが、その際その複素環式基がハ

ロゲン、 $O_1 \sim O_2$ - アルキル、 $O_1 \sim O_4$ - アルコキシ、 $O_1 \sim O_4$ - アルキルチオ、ヒドロキシル、メルカプト、トリフルオロメチル、ニトロ、フェニル、ニトリル、カルボキシルおよび/または $O_1 \sim O_4$ - アルコキシカルボニルによりモノまたはジ(同一かまたは異なる)置換されうる事が可能である)に相当する。

これに関連して R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なることができ、しかも互いに独立して水素、弗素、塩素、臭素、ヒドロキシル、メトキシ、トリフルオロメチル、ニトロおよび/またはメチレンジオキシを表わし、他方 R^3 がチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾ

ンゾチアゾール類およびベンズイミダゾール類からなる群より選択される窒素および/または硫黄元素である1~2個のヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または飽和基を表わすが、その際その複素環式基が弗素、塩素、臭素、メチル、メトキシ、エトキシ、メチルメルカプト、ヒドロキシル、メルカプト、ニトリル、ニトロ、フェニル、カルボキシルおよび/またはメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルによりモノ置換またはジ(同一かまたは異なる)置換されうる事が可能である化合物が特に好ましい。

本発明による化合物の例としては以下のものがあげられる。

2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (3 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ

ール類またはテトラゾール類からなる群より選択される窒素および/または硫黄元素である1~4個のヘテロ原子を有する複素環式の不飽和基または飽和基を表わすが、その際その複素環式基が弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ヒドロキシル、メルカプト、トリフルオロメチル、ニトロ、フェニル、ニトリル、カルボキシルおよび/またはメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルによりモノ置換またはジ(同一かまたは異なる)置換されうる事が可能である化合物が好ましい。

R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なることができ、しかも互いに独立して水素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロおよび/またはメチレンジオキシを表わし、他方 R^3 がチオフエン類、チアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ペ

レナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (4 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、
6 - メチル - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
6 - クロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
6 - メトキシ - 2 - (ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - クロロ - 2 - (ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリジ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

- オン、
 2 - (2 - クロロ - 3 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3 - ヒドロキシ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (6 - ヒドロキシ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (6 - メトキシ - 3 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - テトラヒドロピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3 - カルボキシ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
 2 - (2,6 - ジメチル - 4 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
 2 - (5 - エトキシ - 2 - エチルメルカプト
 2 - (5 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (6 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3,5 - ジクロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2,6 - ジクロロ - 3 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - カルボキシ - 5 - クロロ - 2 - ピ
 リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3 (2H) - オン、
 - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - エトキシカルボニル - 2 - ヒドロ
 キシ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - カルボキシ - 4 - ピリミジニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
 2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト -
 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - クロロ - 2 - メチルメルカプト -
 6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミ
 ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3 (2H) - オン、

2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピリミ
ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3 (2H) - オン、

2 - (2 - クロロ - 5 - ニトロ - 4 - ピリミ
ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3 (2H) - オン、

2 - (4,6 - ジクロロ - 2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4,6 - ジヒドロキシ - 2 - ピリミジニ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
- オン、

2 - (2,6 - ジヒドロキシ - 4 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -

リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3 (2H) - オン、

2 - (1 - フエニルピラゾロ (3,4-d) ピリミ
ジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3 (2H) - オン、

2 - (ピラゾロ (3,4-d) ピリミジン - 4 - イ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
- オン、

2 - (6 - ヒドロキシピラゾロ (3,4-d) ピリ
ミジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (6 - メルカプトピラゾロ (3,4-d) ピリ
ミジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (2 - ヒドロキシ - 4 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

オン、

2 - (2,4 - ジヒドロキシ - 5 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4,6 - ジメルカプト - 2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (6 - ヒドロキシ - 2 - メルカプト - 4
- ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3 (2H) - オン、

2 - (6 - ヒドロキシ - 2 - メチルメルカプ
ト - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (4 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 2 - ピ
リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3 (2H) - オン、

2 - (2 - ヒドロキシ - 5 - メチル - 4 - ピ

2 - (2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (4 - クロロ - 2 - ベンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (6 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4 - メチル - 2 - ベンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (2 - メチル - 5 - ベンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

- 2 - (6 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
- 2 - (6 - ブロモ - 2 - ベンゾチアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
- 2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
- 2 - (6 - エトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、
- 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 6 - メチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 6 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (5 - エトキシカルボニル - 2 - イミダ
 ゴリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3 (2H) - オン、
- 2 - (3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイミ
 ダゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - シアノ - 5 - ピラゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - エトキシカルボニル - 3 - ピラゾ
 リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 6 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 5 - ニトロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 5 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 7 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾ
 リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
 - オン、
- 2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - エトキシカルボニル - 2 - フェニ
 ル - 3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - シアノ - 3 - ピラゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (2 - フェニル - 3 - ピラゾール) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (1 - フェニル - 5 - ピラゾロン - 3 -
 イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
 - オン、
- 2 - (5 - ヒドロキシ - 3 - ピラゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
 オン、

- 2 - (5 -メルカプト - 1,3,4 -チアジアゾ
ール - 2 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、
- 2 - (5 -メチル - 1,3,4 -チアジアゾール
-2-イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、
- 2 - (5 -トリフルオロメチル - 1,3,4 -チ
アジアゾール-2-イル) - 1,2 -ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (5 -第3級ブチル - 1,3,4 -チアジア
ゾール - 2 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2 -ピラジニル) - 1,2 -ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2 -カルボキシ - 3 -ピラジニル) -
1,2 -ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- ル - 3(2H) - オン、
- 2 - (7 -フルオロ - 1,2,4 -ベンゾトリア
ジン - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、
- 2 - (7 -ニトロ - 1,2,4 -ベンゾトリアジ
ン - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - オン、
- 2 - (2 -ベンゾチエニル) - 1,2 -ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (3 -ベンゾチエニル) - 1,2 -ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2 -チエニル) - 1,2 -ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (3 -スルホラニル) - 1,2 -ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2,1,3 -ベンゾチアジアゾール - 4 -
イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)
- 2 - (2 -ピラジニル) - 1,2 -ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2 -ベンズイミダゾリル) - 1,2 -ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (5,6 -ジメチル - 2 -ベンズイミダゾ
リル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)
- オン、
- 2 - (5 -ベンゾトリアゾリル) - 1,2 -ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (7 -クロロ - 1,2,4 -ベンゾトリアジ
ン - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - オン、
- 2 - (1,2,4 -ベンゾトリアジン - 3 -イル)
- 1,2 -ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
オン、
- 2 - (7 -プロモ - 1,2,4 -ベンゾトリアジ
ン - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - オン、
- 2 - (1,2,4 -トリアジン - 4 -イル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (2,6 -ジメルカプト - 1,3,5 -トリア
ジン - 4 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、
- 2 - (5,6 -ジメチル - 1,2,4 -トリアジン
- 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、
- 2 - (5,6 -ジフェニル - 1,2,4 -トリアジ
ン - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - オン、
- 2 - (1,2,4 -トリアゾール - 4 -イル) -
1,2 -ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
- 2 - (5 -メルカプト - 1,2,4 -トリアゾー
ル - 3 -イル) - 1,2 -ベンズイソセレナゾー

ル-3(2H)-オン、
 2-(5-テトラゾリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-キノリル)-1,2-ベンズイソセ
 レナゾール-3(2H)-オン、
 2-(2-メチル-4-キノリル)-1,2-
 ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(6-ニトロ-5-キノリル)-1,2-
 ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(1,2,3,4-テトラヒドロキノール-8
 -イル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-
 3(2H)-オン、
 2-(2-キノリル)-1,2-ベンズイソセ
 レナゾール-3(2H)-オン、
 2-(3-キノリル)-1,2-ベンズイソセ
 レナゾール-3(2H)-オン、
 2-(8-キノリル)-1,2-ベンズイソセ

レナゾール-3(2H)-オン、
 2-(7-インダゾリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(9-エチル-3-カルバゾリル)-1,2
 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(9-テトラヒドロアクリジニル)-1,2
 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(3-ヒドロキシ-2-フエナジニル)
 -1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-
 オンおよび
 2-(4-ヒドロキシ-2-プテリジニル)
 -1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-
 オン。

本発明による式Iのベンズイソセレナゾロン
 類はたとえばW. Kraus氏およびP. Dehne氏に
 による「Das Deut. Gesundheitswesen」第34
 (37)巻第1713~1718頁および同第1769~
 1773頁(1979)により定義されるような免

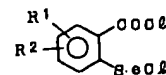
レナゾール-3(2H)-オン、
 2-(6-メトキシ-8-キノリル)-1,2
 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(1-イソキノリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-イソキノリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-インドリル)-1,2-ベンズイソ
 セレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-イソインドリル)-1,2-ベンズ
 イソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-インダゾリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(6-クロロ-3-インダゾリル)-1,2
 -ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(6-インダゾリル)-1,2-ベンズイ
 ソセレナゾール-3(2H)-オン、

疫系統を刺激するためのまたはセレニウム欠乏
 症のための感染症の予防および治療のような多
 数の疾病の治療に使用されりる。

しかしながら、式Iのベンズイソセレナゾロ
 ン類は抗動脈硬化性および消炎性により特に特
 色が示される。それらはたとえば関節炎または
 慢性感染関節炎のようなりウマチ性疾患の治療
 のために特に適しており、しかもこれらの新規
 な化合物は無毒性のために耐容性が非常によい
 点に特色があり、既知の消炎剤に比べてこれら
 は潰瘍形成または胃腸刺激を全然示さない。

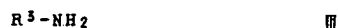
一般式Iの新規なベンズイソセレナゾロン類
 はそれ自体既知の方法で得られる。ここでは式

II



(式中、R1およびR2は式Iに示された意味を

有する)の α -クロロセレンобенゾイルクロライドを閉環条件下で式Ⅲ



(式中、 R^3 は式Ⅰに示された意味を有する)の複炭環式アミンと反応させて式Ⅰのベンズイソセレンアゾロン類を得る。

適切な α -クロロセレンобенゾイルクロライド類の製造はA. RuwetおよびM. Renson両氏による「Bull. Soc. Chim. Belg.」第75巻第157~163頁(1966)に記載の方法により行なわれる。

式Ⅱの適当な出発化合物の例としては以下の化合物があげられる。

2-クロロセレンобенゾイルクロライド、
2-クロロセレン-4-クロロベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-4-フルオロベンゾイル

クロライド、
2-クロロセレン-4-メチルベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-4-メトキシベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-5-クロロベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-5-メトキシベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-5-ニトロベンゾイルクロライド、
2-クロロセレン-3-メトキシベンゾイルクロライドおよび
2-クロロセレン-3,4-メチレンジオキソベンゾイルクロライド。
2-アミノ-3-ヒドロキシピリジン、
2-アミノ-6-ヒドロキシピリジン、

5-アミノ-2-メトキシピリジン、
2-アミノ-3-ニトロピリジン、
2-アミノ-5-ニトロピリジン、
2-アミノ-3-メチルピリジン、
2-アミノ-4-メチルピリジン、
2-アミノ-5-メチルピリジン、
2-アミノ-6-メチルピリジン、
2-アミノピリジン、
3-アミノピリジン、
4-アミノピリジン、
2-アミノ-3,5-ジクロロピリジン、
2-アミノ-4,6-ジメチルピリジン、
3-アミノ-2-クロロピリジン、
2-アミノ-5-クロロピリジン、
2-アミノ-4-クロロピリジン、
3-アミノ-2,6-ジクロロピリジン、
2-アミノ-4-カルボキシ-5-クロロピ

リジン、
2-アミノテトラヒドロピリジン、
2-アミノ-3-カルボキシピリジン、
2-アミノピリミジン、
2-アミノ-4-メチルピリミジン、
2-アミノ-5-ニトロピリミジン、
2-アミノ-4,6-ジメチルピリミジン、
4-アミノ-2,6-ジメチルピリミジン、
4-アミノ-5-エトキシカルボニル-2-エチルメルカプトピリミジン、
4-アミノ-5-エトキシカルボニル-2-ヒドロキシピリミジン、
4-アミノ-5-カルボキシピリミジン、
4-アミノ-6-クロロ-2-メチルメルカプトピリミジン、
6-アミノ-4-クロロ-2-メチルメルカプトピリミジン、

- 2 - アミノ - 4 - クロロ - 6 - メチルピリミジン、
- 2 - アミノ - 6 - クロロ - 3 - ニトロピリミジン、
- 4 - アミノ - 2 - クロロ - 5 - ニトロピリミジン、
- 2 - アミノ - 4,6 - ジクロロピリミジン、
- 5 - アミノ - 4,6 - ジクロロピリミジン、
- 2 - アミノ - 4,6 - ジヒドロキシピリミジン、
- 4 - アミノ - 2,6 - ジヒドロキシピリミジン、
- 5 - アミノ - 2,4 - ジヒドロキシピリミジン、
- 2 - アミノ - 4,6 - ジメルカプトピリミジン、
- 4 - アミノ - 6 - ヒドロキシ - 2 - メルカプトピリミジン、
- 4 - アミノ - 6 - ヒドロキシ - 2 - メチルメルカプトピリミジン、
- 2 - アミノ - 4 - ヒドロキシ - 6 - メチルピリミジン、
- 2 - アミノ - 5,6 - ジメチルベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 6 - エトキシベンゾチアゾール、
- 2 - アミノチオフェン、
- 3 - アミノスルホラン、
- 2 - アミノチアゾール、
- 2 - アミノ - 4 - メチルチアゾール、
- 2 - アミノ - 5 - ニトロチアゾール、
- 2 - アミノ - 2 - チアゾリン、
- 2 - アミノ - 5 - クロロチアゾール、
- 5 - アミノ - 3 - メチルイソチアゾール、
- 2 - アミノイミダゾール、
- 4 - アミノ - 5 - エトキシカルボニルイミダゾール、
- 3 - アミノピラゾール、
- 5 - アミノ - 4 - シアノピラゾール、
- 3 - アミノ - 4 - エトキシカルボニルピラゾール、
- リミジン、
- 4 - アミノ - 1 - フェニルピラゾロ (3,4-d) ピリミジン、
- 4 - アミノピラゾロ (3,4-d) - ピリミジン、
- 4 - アミノ - 6 - ヒドロキシピラゾロ (3,4-d) - ピリミジン、
- 4 - アミノ - 6 - メルカプトピラゾロ (3,4-d) ピリミジン、
- 4 - アミノ - 2 - ヒドロキシピリミジン、
- 2 - アミノベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 4 - クロロベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 4 - メトキシベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 6 - メトキシベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 4 - メチルベンゾチアゾール、
- 5 - アミノ - 2 - メチルベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 6 - ニトロベンゾチアゾール、
- 2 - アミノ - 6 - プロモベンゾチアゾール、
- 3 - アミノ - 4 - エトキシカルボニル - 2 - フェニルピラゾール、
- 3 - アミノ - 4 - シアノピラゾール、
- 3 - アミノ - 2 - フェニルピラゾール、
- 3 - アミノ - 1 - フェニル - 5 - ピラゾロン、
- 3 - アミノ - 5 - ヒドロキシピラゾール、
- 2 - アミノ - 5 - メルカプト - 1,3,4 - チアジアゾール、
- 2 - アミノ - 5 - メチル - 1,3,4 - チアジアゾール、
- 2 - アミノ - 5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジアゾール、
- 2 - アミノ - 5 - 第3級ブチル - 1,3,4 - チアジアゾール、
- 2 - アミノピラジン、
- 3 - アミノ - 2 - カルボキシ - ピラジン、
- 2 - アミノピリダジン、

- 2 - アミノベンズイミダゾール、
 2 - アミノ - 5,6 - ジメチルベンズイミダゾール、
 5 - アミノベンゾトリアゾール、
 3 - アミノ - 7 - クロロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン、
 3 - アミノ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン、
 3 - アミノ - 7 - プロモ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン、
 3 - アミノ - 7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン、
 3 - アミノ - 7 - ニトロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン、
 2 - アミノベンゾチオフェン、
 3 - アミノベンゾチオフェン、
 4 - アミノ - 2,1,3 - ベンゾチアジアゾール、
 3 - アミノ - 1,2,4 - トリアジン、
 4 - アミノ - 2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン、
 3 - アミノ - 5,6 - ジメチル - 1,2,4 - トリアジン、
 8 - アミノ - 5,6 - ジフェニル - 1,2,4 - トリアジン、
 3 - アミノ - 5 - メルカプト - 1,2,4 - トリアゾール、
 4 - アミノ - 1,2,4 - トリアゾール、
 5 - アミノテトラゾール、
 5 - アミノキノリン、
 4 - アミノ - 2 - メチルキノリン、
 5 - アミノ - 6 - ニトロキノリン、
 8 - アミノ - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン、
 2 - アミノキノリン、
 3 - アミノキノリン、
 8 - アミノキノリン、

- 8 - アミノ - 6 - メトキシキノリン、
 1 - アミノイソキノリン、
 5 - アミノイソキノリン、
 5 - アミノインドール、
 5 - アミノインドリン、
 5 - アミノインダゾール、
 3 - アミノ - 6 - クロロインダゾール、
 6 - アミノインダゾール、
 7 - アミノインダゾール、
 3 - アミノ - 9 - エチルカルバゾール、
 9 - アミノ - テトラヒドロアクリジン、
 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシフェナジンおよび
 2 - アミノ - 4 - ヒドロキシプテリジン。

本発明による一般式 I のベンズイソセレナゾロン類は既知の方法で製剤に変換されうる。活性成分として式 I のベンズイソセレナゾロン類

を含有する製剤を調製するには活性成分はそのまままたは適当な薬学的希釈剤および/またはビヒクルと一緒にして用いられそして常法で調製されうる。この活性成分はただし血液または組織中における活性成分の適当な量が確実に保持されるならばたとえ全身系で任意の望ましい形態において人および動物の医薬に使用されうる。これは適当な投与量を経口または直腸または非経口で投与することにより達成されうる。活性成分の製剤はたとえば錠剤、被覆錠剤、カプセル、坐薬、顆粒、溶液、乳濁液、懸濁液、ゾルまたはゲルのような所望される投与に適するよう調整される単一投与量剤形であるのが有利である。これら化合物の投与量は通常は 1 日当り 10~1,000mg、好ましくは 30~300mg でありそしてこれは 1 日に 1 回または数回好ましくは 2~3 回投与されうる。

たとえば錠剤、カプセル、顆粒または粉末の形態における経口投与剤の調製に適するビヒクルの例としては炭酸カルシウム、りん酸カルシウム、澱粉、砂糖、ラクトース、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ソルビトール、微晶性セルロース、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロース、シエラックなどがあげられる。錠剤は従来法で被覆されりる。経口投与のための液体製剤は水性または油性の懸濁液または溶液の形態かまたはシロップまたはエリキシルなどの形態であることができる。これらは常法により調製される。注射用製剤は水性または油性の懸濁液または溶液であることができるしあるいは充填剤と一箱の粉末組成物であることができるしそして使用する前に溶解される凍結乾燥された製剤などであることができる

トリエチルアミンを50 mlの無水テトラヒドロフラン中における13.75 g (0.054 モル)のp-クロロセレンペンゾイルクロライドの溶液に攪拌および水中で冷却(10℃以下の温度)しながら徐々に滴加する。大部分の溶媒は真空中で蒸留しそして残留物は氷水中に庄ぐ。不溶性部分を吸引で除去し、多次の水で洗浄しついでジオキサンから再結晶させる。

収量: 13.17 g (理論値の88.3%), 融点237~239℃

IR(KBr中): 1620 cm^{-1}

MB[m/e] : 276(100%), 196(42.2%), 168(30.4%)
156(34.1%), 138(16.4%), 78(15.2%)

実施例2 2-(3-ヒドロキシ-2-ピリジン)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン

窒素雰囲気下に水中で冷却(約5℃の温度)

る。これらの剤は常法で調製される。また本発明による製剤は直腸投与用の坐薬の形態でもあることができ、その際これらはたとえばポリエチレングリコール、ラノリン、ココアバター、ウイテプゾル(Witepsol[®])などとして知られる薬学的に許容しうるビヒクルを含有することが可能である。外用の製剤は慣用の成分を使用して常法で調製される軟膏またはクリーム[®]の形態で調製されるのが好ましい。

以下に本発明による化合物の製法を実施例により詳細に説明する。

実施例1 2-(2-ピリジン)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン

窒素雰囲気下で120 mlの無水テトラヒドロフラン中に溶解した5.08 g (0.054 モル)の2-アミノピリジンおよび16.6 ml (0.12 モル)の

しながら40 mlの四塩化炭素および50 mlの乾燥ピリジン中における17.6 g (0.016 モル)の2-アミノ-3-ヒドロキシピリジンの酸しく攪拌した溶液に50 mlの四塩化炭素中における4.08 g (0.016 モル)のo-クロロセレンペンゾイルクロライドの溶液を滴加する。この混合物をさらに5時間約10℃で攪拌する。クロロホルムの添加後にその溶液を氷水の中に注ぐ。有機相を水で数回洗浄し、乾燥させそして蒸発させる。残留物はエタノールから再結晶させる。

収量: 2.86 g (理論値の61.3%), 融点238℃

IR(KBr中): 1625 cm^{-1}

MB[m/e] : 292(89%), 275(9.4%), 184(100%),
156(35.2%), 108(10.9%)

実施例3 2-(3-スルホラニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン

窒素雰囲気下で激しく攪拌しそして水中で冷却しながら50 mlの四塩化炭素における255 g(0.01モル)のo-クロロセレンベンゾイルクロライドの溶液に40 mlの四塩化炭素および40 mlの乾燥ピリジン中に溶解させた4.1 g(0.03モル)の3-アミノスルホランを滴加する。3時間攪拌後この混合物に100 mlのクロロホルムを加えそしてそれを100 mlの2N塩液と共に振盪させることにより抽出する。水洗した有機相を蒸発させそして残留物をエタノール/トルエンから再結晶させる。

収量：1.48 g(理論値の66%)、融点128~130°C

IR(KBr中)：1597 cm^{-1}

MB[m/e]：317(75.7%)、225(100%)、212(67%)、
199(52.3%)、184(38.3%)、156(37.8%)、
145(22.4%)、117(16.8%)。

実施例1の操作と同様にして以下のものが製

収率：理論値の72%、融点199~201°C

IR(KBr中)：1666 cm^{-1}

MB[m/e]：310(25%)、275(100%)、247(95%)、
184(11.6%)、156(28%)。

実施例7 2-(2-ピリミジニル)-1,2-
ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-
オン

収率：理論値の88%、融点285°C

IR(KBr中)：1671 cm^{-1}

MB[m/e]：277(100%)、235(78%)、197(19.9%)、
184(16.2%)、169(23.1%)、156(42.6%)、
117(7.9%)。

実施例8 2-(2-チアゾリル)-1,2-
ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-
オン

収率：理論値の72%、融点288~290°C

IR(KBr中)：1658 cm^{-1}

造される。

実施例4 2-(4-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-
オン

収率：理論値の78%、融点259~261°C

IR(KBr中)：1662 cm^{-1}

MB[m/e]：276(70.6%)、196(100%)、184(73%)、
168(14.3%)、156(18%)、138(5.8%)。

実施例5 1-(3-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-
オン

収率：理論値の81%、融点265~267°C

IR(KBr中)：1635 cm^{-1}

MB[m/e]：276(77.9%)、196(100%)、184(76%)、
168(22.8%)、156(18.8%)、138(7.7%)。

実施例6 2-(2-クロロ-3-ピリジル)-
1,2-ベンズイソセレンアゾール-
3(2H)-オン

MB[m/e]：282(85.6%)、234(122%)、202(18.5%)

184(100%)、156(59.5%)、136(11.6%)

117(16%)。

実施例9 2-(ベンゾチアゾリル)-1,2-
ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-
オン

収率：理論値の87%、融点350°C

IR(KBr中)：1657 cm^{-1}

MB[m/e]：332(100%)、252(39.4%)、224(12.9%)、
184(67.6%)、156(62.3%)。

実施例10 2-(5-クロロ-2-ピリジル)-
1,2-ベンズイソセレンアゾール-
3(2H)-オン

収率：理論値の54%、融点267~269°C

IR(KBr中)：1612 cm^{-1}

MB[m/e]：310(100%)、275(14.63%)、230(46.80%)、
202(25.85%)、167(7.65%)、156(33.75%)。

実施例 1.1 2-(6-メトキシ-3-ピリジ
ル)-1,2-ベンズイソセレナゾ
ール-3(2H)-オン

収率：理論値の45%、融点224~225℃

IR(KBr中)：1588 cm^{-1}

MS(m/e)：306(100%)、277(82.3%)、225(45.19%)
197(27.93%)、156(14.49%)、80(23.58%)

実施例 1.2 2-(2,6-ジクロロ-3-ピリ
ジル)-1,2-ベンズイソセレナ
ゾール-3(2H)-オン

収率：理論値の38%、融点194~195℃

IR(KBr中)：1623 cm^{-1}

MS(m/e)：344(22.0%)、309(100%)、184(11.5%)、
156(26.3%)

実施例 1.3 2-(4,6-ジメチル-2-ピリ
ジル)-1,2-ベンズイソセレナ
ゾール-3(2H)-オン

5-ニトロ-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

5-クロロ-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

7-メトキシ-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

6,7-メチレンジオキシ-2-(2-ピリジ
ル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)
-オン、

2-(3-メチル-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-メチル-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(5-メチル-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(6-メチル-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

収率：理論値の77%、融点238~241℃

MS(m/e)：304(100%)、224(64.50%)、196(13.54%)、
77(16.10%)

実施例 1~3に記載の操作と同様にして以下
のものが製造される。

2-(6-ヒドロキシ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(3-ニトロ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(5-ニトロ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

6-メチル-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

6-クロロ-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

6-メトキシ-2-(2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-クロロ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-カルボキシ-5-クロロ-2-ピ
リジル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-
3(2H)-オン、

2-(2-テトラヒドロピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(3-カルボキシ-2-ピリジル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-メチル-2-ピリミジニル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(5-ニトロ-2-ピリミジニル)-1,2-
ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(4,6-ジメチル-2-ピリミジニル)-
1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-

- オン、
- 2 - (2,6 - ジメチル - 4 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H) -
オン、
- 2 - (5 - エトキシ - 2 - エチルメルカプト
- 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
レンアゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (5 - エトキシカルボニル - 2 - ヒドロ
キシ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソ
セレンアゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (5 - カルボキシ - 4 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H) -
オン、
- 2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト -
4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレン
アゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - クロロ - 2 - メチルメルカプト -
6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレン
アゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4,6 - ジヒドロキシ - 2 - ピリミジニ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H)
- オン、
- 2 - (2,6 - ジヒドロキシ - 4 - ピリミジニ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H)
- オン、
- 2 - (2,4 - ジヒドロキシ - 5 - ピリミジニ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H)
- オン、
- 2 - (4,6 - ジメルカプト - 2 - ピリミジニ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H)
- オン、
- 2 - (6 - ヒドロキシ - 2 - メルカプト - 4
- ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンア
ゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (6 - ヒドロキシ - 2 - メチルメルカプ
ト - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
レンアゾール - 3 (2H) - オン、
- 6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレン
アゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミ
ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール -
3 (2H) - オン、
- 2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピリミ
ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール -
3 (2H) - オン、
- 2 - (2 - クロロ - 5 - ニトロ - 4 - ピリミ
ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール -
3 (2H) - オン、
- 2 - (4,3 - ジクロロ - 2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H) -
オン、
- 2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H) -
オン、
- レナゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (4 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 2 - ピ
リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール
- 3 (2H) - オン、
- 2 - (2 - ヒドロキシ - 5 - メチル - 4 - ピ
リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール
- 3 (2H) - オン、
- 2 - (1 - フェニルピラゾロ (3,4-d) ピリミ
ジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレンア
ゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (ピラゾロ (3,4-d) ピリミジン - 4 - イ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレンアゾール - 3 (2H)
- オン、
- 2 - (6 - ヒドロキシピラゾロ (3,4-d) ピリ
ミジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレン
アゾール - 3 (2H) - オン、
- 2 - (6 - メルカプトピラゾロ (3,4-d) ピリ

ミジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (2 - ヒドロキシ - 4 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4 - クロロ - 2 - ペンゾチアゾール)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4 - メトキシ - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (6 - メトキシ - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (4 - メチル - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

6 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

6 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

5 - ニトロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

5 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

7 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾ
リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
- オン、

2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (2 - メチル - 5 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (6 - ニトロ - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (6 - ブロモ - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ペンゾチアゾリ
ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H)
- オン、

2 - (6 - エトキシ - 2 - ペンゾチアゾリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) -
オン、

6 - メチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (2 - チアゾリニル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オ
ン、

2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (5 - エトキシカルボニル - 2 - イミダ
ゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3 (2H) - オン、

2 - (3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイン
セレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (4 - シアノ - 5 - ピラゾリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、

2 - (4 - エトキシカルボニル - 3 - ピラゾ

- リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - エトキシカルボニル - 2 - フェニル - 3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (4 - シアノ - 3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - フェニル - 3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (1 - フェニル - 5 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (1 - フェニル - 5 - ピラズロン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - ヒドロキシ - 3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - カルボキシ - 3 - ピラジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - ピリダジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - ベンゾトリアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (7 - クロロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (1,3,4 - テアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - メルカプト - 1,3,4 - テアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - メチル - 1,3,4 - テアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - テアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (5 - 第3級ブチル - 1,3,4 - テアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - ピラジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (7 - ブロモ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (7 - ニトロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (3 - ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2 - チエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3 (2H) - オン、
 2 - (2,1,3 - ベンゾチアジアゾール - 4 -

イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (1,2,4 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5,6 - ジフェニル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - メルカプト - 1,2,4 - トリアゾール -

2 - (8 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (6 - メトキシ - 8 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (1 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - インドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - イソインドイル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (6 - クロロ - 3 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (6 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイ

ル - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - テトラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (2 - メチル - 4 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (6 - ニトロ - 5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (1,2,3,4 - テトラヒドロキノール - 8 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (2 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (3 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

ソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (7 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (9 - エチル - 3 - カルバゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (9 - テトラヒドロアクリジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (3 - ヒドロキシ - 2 - フェナジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オンおよび

2 - (4 - ヒドロキシ - 2 - プテリジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン。

特許出願人 アー・ナツターマン・ウント・シー・ゲゼルクヤフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング

代理人 弁理士 山下



第1頁の続き

⑤Int. Cl. ³	識別記号	庁内整理番号	⑥Int. Cl. ³	識別記号	庁内整理番号
A 61 K 31/505		7169-4C	(C 07 D 421/04		
31/53		7169-4C	235/00		6917-4C
//(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
209/00		7132-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	237/00		6970-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
213/00		7138-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	239/00		6970-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
215/00		6675-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	241/00		6970-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
217/00		6675-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	249/00		7132-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
219/00		6675-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	251/00		7132-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
231/00		6917-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	253/00		7132-4C
(C 07 D 421/04			293/00)		7330-4C
233/00		7133-4C	(C 07 D 421/04		
293/00)		7330-4C	257/00		7132-4C
			293/00)		7330-4C

⑤Int. Cl. ³	識別記号	庁内整理番号
(C 07 D 421/04		
277/00		7330-4C
293/00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		
285/00		7330-4C
293/00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		
333/00		8214-4C
293/00)		7330-4C

⑦発明者 シグルト・レイツク
 ドイツ連邦共和国デー - 5024ブ
 ルハイム 2 アム・クヴェツヒエ
 ンハウフ 21

⑧発明者 オイゲン・エツチエンベルク
 ドイツ連邦共和国デー - 5000ケ
 ルン 41・ヒルゼヴェーク 10